

P C T

## 国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)  
[PCT36条及びPCT規則70]

REC'D 21 MAY 2004

WIPO

PCT

出願人又は代理人 の書類記号 1494	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式PCT/ IPEA/416）を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/08079	国際出願日 (日.月.年) 26.06.2003	優先日 (日.月.年) 26.06.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl <sup>7</sup> A61K31/47, 31/496, 31/5377, 45/00, C07D215/18, 215/42, 215/50, 215/52, A61P1/00, 3/10, 9/00, 9/10, 9/12, 11/00, 13/12, 15/00, 19/10, 25/00, 25/04, 25/14, 25/16, 25/28/, 29/00, 35/00, 37/02, 37/08, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) 協和醗酵工業株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 8 ページからなる。
- ☐ この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。  
(PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照)  
この附属書類は、全部で ページである。

3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- I ☒ 国際予備審査報告の基礎
- II ☐ 優先権
- III ☒ 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- IV ☒ 発明の単一性の欠如
- V ☒ PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- VI ☒ ある種の引用文献
- VII ☐ 国際出願の不備
- VIII ☐ 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 25.12.2003	国際予備審査報告を作成した日 30.04.2004		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 榎本 佳予子	4P	9638
電話番号 03-3581-1101 内線 3492			

## I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に  
 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。  
 PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- |                                     |                |                      |
|-------------------------------------|----------------|----------------------|
| <input type="checkbox"/> 明細書        | 第 _____ ページ、   | 出願時に提出されたもの          |
| <input type="checkbox"/> 明細書        | 第 _____ ページ、   | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書        | 第 _____ ページ、   | 付の書簡と共に提出されたもの       |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲      | 第 _____ 項、     | 出願時に提出されたもの          |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲      | 第 _____ 項、     | PCT19条の規定に基づき補正されたもの |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲      | 第 _____ 項、     | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲      | 第 _____ 項、     | 付の書簡と共に提出されたもの       |
| <input type="checkbox"/> 図面         | 第 _____ ページ/図、 | 出願時に提出されたもの          |
| <input type="checkbox"/> 図面         | 第 _____ ページ/図、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 図面         | 第 _____ ページ/図、 | 付の書簡と共に提出されたもの       |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 _____ ページ、   | 出願時に提出されたもの          |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 _____ ページ、   | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 _____ ページ、   | 付の書簡と共に提出されたもの       |

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である \_\_\_\_\_ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語  
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語  
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表  
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表  
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表  
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表  
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった  
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 図面の第 \_\_\_\_\_ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならない、本報告に添付する。)

## Ⅲ. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 28-31, 33

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 28-31, 33 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 28-31 及び 33 は手術又は治療による人体の処置方法であり、この国際予備審査機関が国際予備審査をすることを要しない対象に係るものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 28-31, 33 について、国際調査報告が作成されていない。

2. スクレオチド又はアミノ酸の配列表が実施細則の附属書 C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を満たしていないので、有効な国際予備審査をすることができない。

☐ 書面による配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

☐ 磁気ディスクによる配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

## IV. 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☐ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☒ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲 9 に記載の一般式 (IA) で表される化合物群に共通する化学構造は、国際調査報告において提示される文献等に記載されるように公知のものであるから、重要な化学構造要素であるとは認められない。したがって、これらの発明群は単一の一般的発明概念を形成するように連関しているとは認められない。

よって、本出願は、発明の単一性の要件を満たしていない。

4. したがって、この国際予備審査報告書を作成するに際して、国際出願の次の部分を、国際予備審査の対象にした。

☐ すべての部分

☒ 請求の範囲 1-27, 32 に関する部分

## V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

## 新規性(N)

請求の範囲	12, 18-20, 26, 27, 32	有
請求の範囲	1-11, 13-17, 21-25	無

## 進歩性(IS)

請求の範囲	12, 18, 26	有
請求の範囲	1-11, 13-17, 19-25, 27, 32	無

## 産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲	1-27, 32	有
請求の範囲		無

## 2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

## (文献)

1. EP 133244 A2 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 1985.02.20
2. EP 362578 A1 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 1990.04.11
3. Biochemical Pharmacology, (1990), Vol.40, No.4, p.709-14
4. WO 02/36568 A1 (ASTRAZENECA AB) 2002.05.10
5. Periodicum Biologorum, (2001), Vol.103, No.4, p.321-325
6. Polish Journal of Pharmacology and Pharmacy, (1986), Vol.38, No.1, p.115-24
7. Bioorganic & Medicinal Chemistry, (2001), Vol.9, No.12, p.3273-3286
8. J. Med. Chem., (1998), Vol.41, No.12, p.2029-2039
9. US 5780634 A (THE GREEN CROSS CORPORATION) 1998.07.14
10. WO 00/31037 A1 (SMITHKLINE BEECHAM S.P.A.) 2000.06.02
11. WO 02/44165 A1 (GLAXOSMITHKLINE SPA) 2002.06.06
12. WO 02/38547 A1 (GLAXOSMITHKLINE SPA) 2002.05.16
13. WO 97/19927 A1 (SMITHKLINE BEECHAM S.P.A.) 1997.06.05
14. WO 97/19926 A1 (SMITHKLINE BEECHAM S.P.A.) 1997.06.05
15. WO 95/32948 A1 (SMITHKLINE BEECHAM S.P.A.) 1995.12.07
16. EP 755685 A1 (MEIJI SEIKA KAISHA LTD.) 1997.01.29
17. WO 01/32170 A1 (SWOPE, David, M.) 2001.05.10
18. J. Biol. Chem., (1999) Vol.274, No.26, p.18438-18445

(続き有り)

## VI. ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
US 2003/0018047 A1 [EX]	23. 01. 2003	03. 05. 2002	20. 04. 2001

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 V 欄の続き 1

(説明)

請求の範囲 1～8、22 及び 24 について

請求の範囲 1～8、22 及び 24 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献 1～6 及び 10～15 から新規性及び進歩性を有しない。

文献 1～3 には本願の請求の範囲 1～8 のいずれかに記載の化合物を有効成分とする抗腫瘍剤が、文献 4～6 には本願の請求の範囲 1～8 のいずれかに記載の化合物を有効成分とする鎮痛剤や抗炎症剤が、文献 10～15 には本願の請求の範囲 1、2、4 及び 8 のいずれかに記載の化合物を有効成分とする炎症やアレルギー、高血圧、ハンチントン病、アルツハイマー病、パーキンソン病等の疾患の治療剤がそれぞれ開示されている。そして、本願明細書には、本願発明における「ホスホジエステラーゼ 1 0 A 阻害剤」が、腫瘍、痛み、炎症、アレルギー、高血圧、ハンチントン病、アルツハイマー病、パーキンソン病等の疾患の治療又は予防剤として用いられることが記載されていることからすると、請求の範囲 1～8、22 及び 24 に係る発明は、文献 1～6 及び 10～15 に記載された発明と相違するものではない。

また、医薬の分野において、薬理作用を有する化合物を適宜修飾してみることは、通常行われていることであるから、文献 1～6 又は 10～15 に記載される化合物中の置換基等を適宜変換してその薬理作用を確認してみることも、当業者であれば容易に想到し得たことである。

請求の範囲 9～11 及び 13～15 について

請求の範囲 9～11 及び 13～15 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献 4～11 から新規性及び進歩性を有しない。

文献 4～11 には、本願の請求の範囲 9～11 及び 13～15 のいずれかに記載の化合物がそれぞれ開示されている。

また、医薬の分野において、薬理作用を有する化合物を適宜修飾してみることは、通常行われていることであるから、文献 4～6 又は 10 に記載される化合物中の置換基等を適宜変換してみることも、当業者であれば容易に想到し得たことである。

請求の範囲 12 について

請求の範囲 12 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献に対して新規性及び進歩性を有する。

文献 1～18 には、請求の範囲 9 に記載の一般式 (IA) における R 3 A が 4 位に置換又は非置換のアリール基を有するピペラジーン-1-イルである化合物が記載されており、しかも、当該化合物は、文献 1～18 の記載から当業者といえども容易に想到し得ないものである。

請求の範囲 16、17、21、23 及び 25 について

請求の範囲 16、17、21、23 及び 25 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献 4～6 から新規性及び進歩性を有しない。

文献 4～6 には、本願の請求の範囲 9、13 及び 14 のいずれかに記載の化合物を有効成分とする鎮痛剤や抗炎症剤が開示されている。

また、請求の範囲 16、17、21、23 及び 25 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献 1～6 から進歩性を有しない。

医薬の分野において、薬理作用を有する化合物を適宜修飾してみることは、通常行われていることであるから、文献 1～6 に記載される化合物中の置換基等を適宜変換してその薬理作用を確認してみることも、当業者であれば容易に想到し得たことである。

(続き有り)

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

## 第 V 欄の続き 2

請求の範囲 18 及び 26 について

請求の範囲 18 及び 26 に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献に対して新規性及び進歩性を有する。

文献 1～18 には、請求の範囲 9～15 のいずれかに記載の化合物がジスキネジアの治療又は予防に有効であることが記載されておらず、しかも、その点は、文献 1～18 の記載から当業者といえども容易に想到し得ないものである。

請求の範囲 19 及び 27 について

請求の範囲 19 及び 27 に係る発明は、国際調査報告で引用された何れの文献にも開示されておらず、新規性を有するが、国際調査報告で引用された文献 1～3 から進歩性を有しない。

文献 1～3 には、請求の範囲 9～15 に記載される化合物と類似の構造を有する化合物を有効成分とする抗腫瘍剤が記載されている。そして、医薬の分野において、薬理作用を有する化合物を適宜修飾してみることは、通常行われていることであるから、文献 1～3 に記載される化合物中の置換基等を適宜変換してその薬理作用を確認してみることは、当業者であれば容易に想到し得たことである。

請求の範囲 20 及び 32 について

請求の範囲 20 及び 32 に係る発明は、国際調査報告で引用された何れの文献にも開示されておらず、新規性を有するが、国際調査報告で引用された文献 16～18 から進歩性を有しない。

文献 16 及び 17 には、ホスホジエステラーゼ阻害作用を有する化合物がジスキネジアの治療に有効であることが開示されており、さらに、文献 16 には、その機作として、脳細胞内の cAMP 量の減少に起因してジスキネジア症状が引き起こされると考えられることから、cAMP を加水分解する酵素であるホスホジエステラーゼを阻害することにより脳内の cAMP 濃度を上昇させることが記載されている。そして、引用文献 18 には、cAMP を加水分解するホスホジエステラーゼの 1 つとして、ホスホジエステラーゼ 10A が記載されていることからすると、ホスホジエステラーゼ 10A 阻害作用を有する化合物をジスキネジアの治療又は予防に適用してみることは、当業者であれば容易に想到し得たことである。